

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

(法第12条、法施行規則第56条)  
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 664044	今後の手続きについては、様式PCT/ IPEA/ 416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/12320	国際出願日 (日.月.年) 26.09.2003	優先日 (日.月.年) 27.09.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. C07D473/18, 473/16, 473/24, 473/34, 473/40, A61K31/522, 31/5377, 31/55, A61P11/06, 17/00, 31/12, 35/00, 37/02, 37/08, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 住友製薬株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a ☐ 附属書類は全部で ページである。

☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)

☐ 第I欄4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎

☐ 第II欄 優先権

☐ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如

☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

☐ 第VI欄 ある種の引用文献

☐ 第VII欄 国際出願の不備

☐ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 26.04.2004	国際予備審査報告を作成した日 08.10.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員)	4P 9282
	中木 亜希 電話番号 03-3581-1101 内線 3492	

様式PCT/ IPEA/ 409 (表紙) (2004年1月)

第1欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

- ☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。
- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
- ☐ PCT規則12.4にいう国際公開
- ☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	1-46	有
	請求の範囲		無
進歩性(IS)	請求の範囲	5-7, 10, 12, 13, 16-25, 28, 29	有
	請求の範囲	1-4, 8, 9, 11, 14, 15, 26, 27, 30-46	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-46	有
	請求の範囲		無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

1. WO 99/28321 A1
2. JP 11-193282 A
3. EP 1043021 A1
4. WO 98/01448 A1

## I. 請求の範囲1-4, 8, 9, 11

文献1には、一般式(I)で表される化合物を有効成分とする医薬が記載されている。一般式(I)の具体的な化合物である実施例39, 40, 45及び62の化合物は、本願の一般式(1)の化合物に相当し、また、第27頁第16~17行には、医薬の剤型として経皮剤、噴霧剤等が例示されていることから、実施例39, 40, 45又は62の化合物を経皮剤又は噴霧剤にしてみることは当業者が容易に成し得たことである。

以上より、本願請求の範囲1-4, 8, 9及び11に記載された発明は、文献1より進歩性を有しない。

## II. 請求の範囲14, 15, 26, 27, 30-46

文献1には、インターフェロン誘導剤、抗ウイルス剤、抗癌剤等に有用な一般式(I)で表される化合物が記載されており、具体的な化合物として、R<sup>1</sup>が低級アルコシカルボニル基で置換されたアルキル基である化合物(実施例39, 40, 45及び62参照)が記載されている。

また、文献2には、文献1に記載の化合物と類似の化学構造を有し、かつ、同様の活性を有する一般式(1)で表される化合物が記載されており、R<sup>2</sup>(文献1のR<sup>1</sup>に相当)として、アルコシカルボニル基と並んでアルキルカルバモイル基が例示されている。

ここで、医薬に用いられる化合物の技術分野において、末端の置換基を改変し、医薬として最適又は好適な化合物を得ることは当業者が通常よく行うことであるから、文献1に記載の化合物において、アルキル基部分をアルケニル基等に代えたり、オキシカルボニル基をカルバモイル基等に変更してみることは、当業者が容易に想到し得たことである。

そして、本願請求の範囲14及び15に記載された化合物が、文献1に記載の化合物に比較して格別顕著な効果を奏するとも認められない。

以上より、本願請求の範囲14, 15, 26, 27, 30-46に記載された発明は、文献1及び2により進歩性を有しない。

(続き有)

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

## I I I. 請求の範囲 5-7, 10

文献 1 及び 2 のいずれにも、9 位のベンジル基が本願の  $-Y^2-Q^2$  に相当する置換基で置換された化合物を局所投与すると速やかに代謝され低活性物質に変化することは記載も示唆もされておらず、また、該事項が当業者にとって自明であったとも認められない。

以上より、本願請求の範囲 5-7 及び 10 に記載された発明は、文献 1 及び 2 に対して新規性及び進歩性を有する。

## I V. 請求の範囲 12, 13, 16-25, 28, 29

文献 1-4 のいずれにも、本願請求の範囲 12, 13, 16-25 に記載の化合物は記載も示唆もされておらず、また、該化合物に想到することが当業者にとって自明であったとも認められない。

以上より、本願請求の範囲 12, 13, 16-25, 28 及び 29 に記載された発明は、文献 1 及び 2 に対して新規性及び進歩性を有する。